

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
29. März 2001 (29.03.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 01/21619 A1

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 475/08, A61K 31/519, A61P 9/00, C07D 239/50

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): VASOPHARM BIOTECH GMBH & CO. KG [DE/DE]; Sedanstrasse 27, 97082 Würzburg (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/08833

(72) Erfinder; und

(22) Internationales Anmeldedatum:  
11. September 2000 (11.09.2000)

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): PFLEIDERER, Wolfgang [DE/DE]; Lindauer Strasse 47, 78464 Konstanz (DE). SCHMIDT, Harald [DE/DE]; Langes Gräthlein 26, 97078 Würzburg (DE). FRÖHLICH, Lothar [DE/DE]; Amalienstrasse 5, 97072 Würzburg (DE). KOTSONIS, Peter [DE/DE]; Sandweg 1, 97078 Würzburg (DE). TAGHAVI-MOGHADAM, Shahriyar [IR/DE]; Schottenstrasse 71, 78462 Konstanz (DE).

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

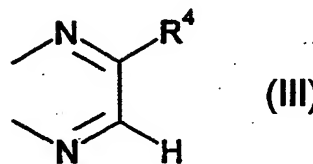
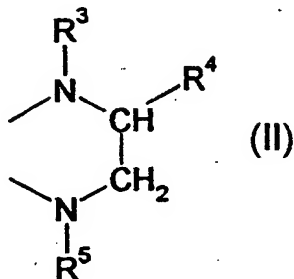
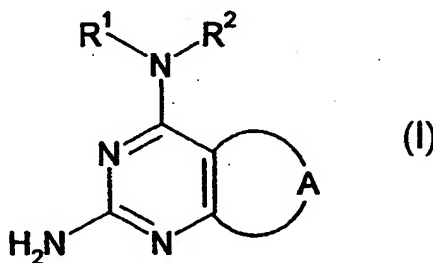
(30) Angaben zur Priorität:  
199 44 767.5 17. September 1999 (17.09.1999) DE

(74) Anwalt: ACKERMANN, Joachim; Postfach 11 13 26, 60048 Frankfurt am Main (DE).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: N-SUBSTITUTED 4-AMINOPTERIDINES, SYNTHESIS AND USE THEREOF AS PHARMACEUTICAL AGENT

(54) Bezeichnung: N-SUBSTITUIERTE 4-AMINOPTERIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ALS ARZNEIMITTEL



(57) Abstract: Compounds of formula (I), where preferably: A = a bridge of partial formula (II) or (III), R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> = independently (substituted) alkyl, aryl or aralkyl, or together form a heterocycle, R<sup>3</sup> = H, -CO-Alkyl, or -CO-Aryl, R<sup>4</sup> = Aryl, -CO-O-Aryl or -CO-Aryl and R<sup>5</sup> = H, are potent inhibitors of NO-synthase and are suitable as pharmaceutical agents for prophylaxis and treatment of disease states associated with a disturbed NO metabolism.

(57) Zusammenfassung: Verbindungen der Formel (I) in der bevorzugt A für eine Verbrückung der Form (II) ODER (III) steht, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> unabhängig voneinander (substituiertes) Alkyl, Aryl oder Aralkyl oder zusammen einen Heterozyklus bilden, R<sup>3</sup> für Wasserstoff, -CO-Alkyl, oder -CO-Aryl, R<sup>4</sup> Aryl, -CO-O-Aryl oder -CO-Aryl und R<sup>5</sup>

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

BEST AVAILABLE COPY

WO 01/21619 A1



(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI-Patent

(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Veröffentlicht:**

- Mit internationalem Recherchenbericht.
- Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen.

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

BEST AVAILABLE COPY